

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
14. Juli 2005 (14.07.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/063277 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 38/15,
31/395, C07K 11/02, C07D 273/00, A61P 33/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/013896

(22) Internationales Anmeldedatum:
7. Dezember 2004 (07.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10359798.0 19. Dezember 2003 (19.12.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Lev-
erkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): JESCHKE, Peter
[DE/DE]; Kalmüntener Str. 44a, 51467 Bergisch Glad-
bach (DE). HARDER, Achim [DE/DE]; Europaring 54,
51109 Köln (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG;
Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen
(DE).

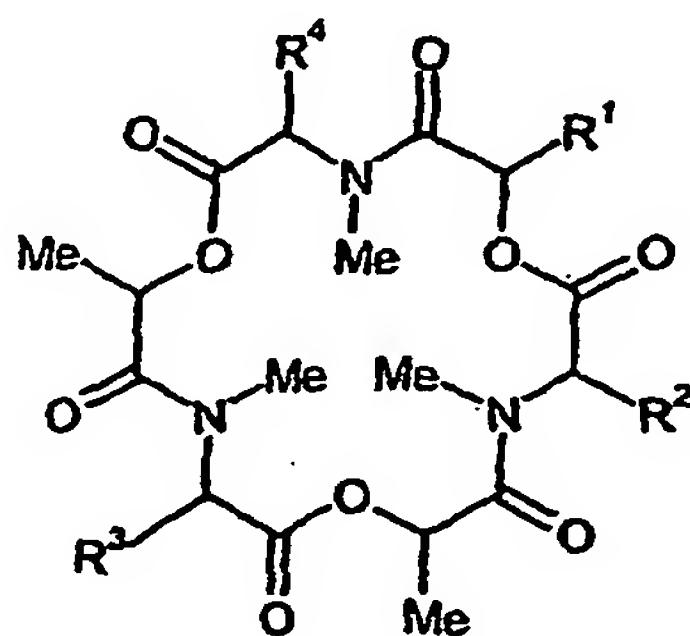
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 18-MEMBERED NITROBENZYL-SUBSTITUTED AND AMINOBENZYL-SUBSTITUTED CYCLOHEXADEP-
SIPEPTIDES FOR CONTROLLING ENDOPARASITES, AND METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF

(54) Bezeichnung: 18 GLIEDRIGE NITROBENZYL-UND AMINOBENZYL-SUBSTITUIERTE CYCLOHEXADEPSIPEP-
TIDE ZUR BEKÄMPFUNG VON ENDOPARASITEN UND EIN VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG



(I)

(57) Abstract: The invention relates to cyclic depsipeptides, especially
18-membered cyclohexadepsipeptides of general formula (I) and the salts
thereof, wherein R¹ represents nitrobenzyl or R'R''N-benzyl - wherein
R' and R'' independently represent hydrogen, optionally substituted
C₁-C₄-alkyl, formyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, or
hydroxy-C₁-C₂-alkyl-sulfonyl-C₁-C₂-alkyl, or, together with the nitrogen
atom to which they are bound, R' and R'' form an optionally substituted
monocyclic or polycyclic, optionally bridged and/or spirocyclic, saturated
or unsaturated heterocycle containing between one and three other
heteroatoms from the group of nitrogen, oxygen and sulphur, or R'
and R'' together form C₃-C₅-alkylene monocarbonyl or an optionally
substituted diacyl radical of a C₄-C₆-dicarboxylic acid - and R², R³ and
R⁴ independently represent C₁-C₄-alkyl. The invention also relates to the

optical isomers and racemates of said cyclic depsipeptides, to a method for the production thereof, and to the use of the same for
controlling endoparasites.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft cyclische Depsipeptide, insbesondere 18-gliedrige Cyclohexadepsipep-
tide, der allgemeinen Formel (I) und deren Salze, in welcher R¹ für Nitrobenzyl oder R'R''N-Benzyl steht, worin R' und R'' unab-
hängig voneinander jeweils Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C₁-C₄-alkyl, Formyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alko-
xycarbonyl, Hydroxy-C₁-C₂-alkyl-sulfonyl-C₁-C₂-alkyl bedeuten oder R' und R'' gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie ge-
bunden sind, einen gegebenenfalls substituierten mono- oder polycyclischen, gegebenenfalls überbrückten und/oder spirocyclischen,
gegebenenfalls überbrückten und/oder spirocyclischen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclen bilden, der ein bis drei weitere
Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthält, oder R' und R'' gemeinsam C₃-C₅-Alkylenmonocarbonyl
oder einen gegebenenfalls substituierten Diacylrest einer C₄-C₆-Dicarbonsäure bilden, und R², R³ und R⁴ unabhängig voneinander
für C₁-C₄-Alkyl stehen, sowie deren optische Isomere und Racemate, ein Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur
Bekämpfung von Endoparasiten.

WO 2005/063277 A1



PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.